手続補正

(法第11条の規定による補正)



特許庁長官

1. 国際出願の表示

PCT/IP03/14610

2. 出願人

(1)称 池田壽文

IKEDA Hisafumi

あて名 〒270-0115

日本国千葉県流山市江戸川台西三丁目 31 番地の 1

エステート江戸川台 8-307

Room 307, Estate Edogawadai 8, 31-1, Edogawadai Nishi

3-chome, Nagareyama-shi, Chiba 270-0115 JAPAN

国 籍 日本国

Japan

所 住

日本国

Japan

(2)児玉俊太郎 名

KODAMA Shuntaro

あて名

〒354-0031

日本国埼玉県富士見市大字勝瀬3369番地

アイムふじみ野西三番館301

Room 301, Aimu Fujimino Nishi Sanbankan, 3369,

Oaza Katsuse, Fujimi-shi, Saitama 354-0031 JAPAN

玉 籍 日本国

Japan

住 所

日本国 · Japan

(3) 名 外崎 円 称

TONOSAKI Madoka

あて名

〒344-0054

日本国埼玉県春日部市浜川戸一丁目14番地4

14-4, Hamakawado 1-chome, Kasukabe-shi,

Saitama 344-0054 JAPAN

国 籍

日本国

Japan

住 所

日本国

Japan

(4) 名 称

北川文彦

KITAGAWA Fumihiko

あて名

〒278-0022

日本国千葉県野田市山崎2185番地の1

杉エグゼクティブカレッジ 107 号

Room 107, Sugi Executive College, 2185-1, Yamazaki,

Noda-shi, Chiba 278-0022 JAPAN

国 籍

日本国

Japan

住 所

日本国

Japan

3. 代理人

氏 名

(8469) 弁理士 赤 尾 直

AKAO Naoto

あて名

〒113-0034

日本国東京都文京区湯島四丁目8番1号

レオ竜岡402号

Room402, Leo-Tatsuoka, 8-1, Yushima 4-chome,

Bunkyo-ku, Tokyo 113-0034 JAPAN

4. 補正の対象

明細書、請求の範囲

5. 補正の内容

(1)(a) 明細書11頁7行ないし11行の「下記一般式(I): ………化 合物」を下記のように訂正する。

記

すなわち、本発明は、下記一般式 (I):

【化23】

(式中、Rは下記の機能性分子の群から選択され、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)

によって表される化合物に関する。

【化24】

- (b) 明細書11頁12行ないし12頁3行の、「また、本発明は、………前 記化合物に関する。」を削除する。
- (c) 明細書12頁7行の「RはH、機能性分子または保護基を表し、」の部分を「Rは機能性分子または保護基を表し、」と訂正する。
- (d) 明細書の13頁第3行および、第8行の「RはH、機能性分子または保護基を表し、」の部分をそれぞれ「Rは機能性分子または保護基を表し、」と訂正する。
- (e) 明細書14頁第3行の「RはH、機能性分子または保護基を表し、」を「Rは機能性分子または保護基を表し、」と訂正する。

(f) 明細書14頁1行ないし6行の「【化30】……前記方法に関する。」 記

【化30】

(式中、BはH、機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)

で表される化合物の1種または2種以上を結合したPNAオリゴマーにおいてBのうち、H、または保護基の一部またはすべてについて順次または同時に機能性分子によって置換する工程を含む、前記方法に関する。

(g)明細書14頁7行ないし10行の「またさらに、本発明は、Rが、……… 前記方法に関する。」の部分を下記のように訂正する。

記

またさらに、本発明は、Rが、

【化31】

からなる群から選択される、前記方法に関する。

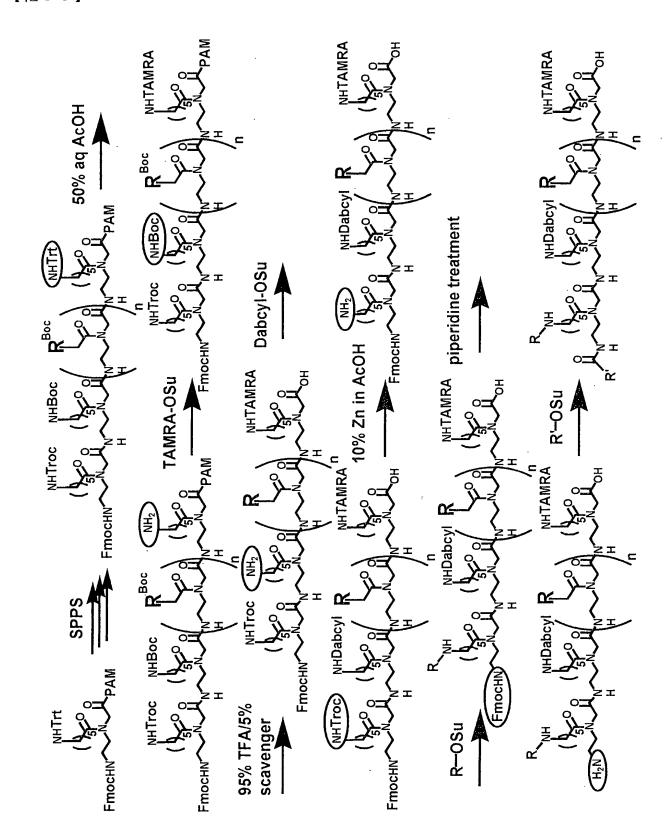
(h)明細書15頁6行および11行の「RはH、機能性分子または保護基を表し、」の部分をそれぞれ「Rは機能性分子または保護基を表し、」と訂正する。

(i) 明細書の31頁全体を下記のように訂正する。

記

(j) 明細書32頁を下記のように訂正する。

記



(2)(a)請求の範囲第1項を下記のように訂正する。

下記一般式 (I):

【化1】

(式中、Rは下記の機能性分子の群から選択され、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)

によって表される化合物。

【化2】

(b)請求の範囲第2項、第3項、第4項、第5項を削除する。

(c)請求の範囲第6項を下記のように訂正する。

記

下記一般式(I):

【化3】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を製造するための方法であって、下記工程a) $\sim c$) の1つを含む、前記方法:

a) 下記一般式(II)

【化4】

(式中、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を、機能性分子のOSuまたはOPfpとの活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

b) 下記一般式(III)

`【化5】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を、加水分解する工程、および

c) 下記一般式(IV)

【化6】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を、下記一般式 (V)

【化7】

$$F_{\text{Moc}} \stackrel{\text{H}}{\sim} \stackrel{\text{O}}{\sim} OH \stackrel{\text{(V)}}{\sim} OH$$

で表される化合物と反応せしめる工程。

(d)請求の範囲第7項を下記のように訂正する。

記

機能性PNAオリゴマーを製造するための方法であって、下記一般式(I) 【化8】

(式中、BはH、機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)

で表される化合物の1種または2種以上を結合したPNAオリゴマーにおいてBのうち、H、または保護基の一部またはすべてについて順次または同時に機能性分子によって置換する工程を含む、前記方法。

(e)請求の範囲第8項を下記のように訂正する。

記

Bにおける機能性分子が、

【化9】

からなる群から選択される、前記請求の範囲第10項に記載の方法。

(f)請求の範囲第9項を下記のように訂正する。

記

一般式 (I.) で表される化合物が、下記 a.) $\sim c$.) の工程の 1 つによって製造される、前記請求の範囲第 6 項または第 7 項に記載の方法:

a) 下記一般式(II)

【化10】

(式中、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を、機能性分子の OSuまたはOPfpとの活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

b) 下記一般式(III)

【化11】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を、加水分解する工程、および

c) 下記一般式(IV)

【化12】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を、下記一般式 (V)

【化13】

で表される化合物と反応せしめる工程。

- 6. 添付書類の目録 (1) 明細書第11頁、第12頁、第13頁、第14頁、 第15頁、第31頁、第32頁
 - (2)請求の範囲第45頁、第46頁、第47頁、第48 頁、第49頁

発明の開示

上記課題に鑑み研究を重ねた結果、本発明者らは、多岐にわたる新規な前駆体的Fmoc型PNAモノマーユニットおよびその製造方法を用いることによって、驚くべきことに、従来法における前記課題が克服され、かつ極めて広範にわたる機能性PNAモノマーユニットおよび機能性PNAオリゴマーを合成できることを見出し、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明は、下記一般式(I):

【化23】

(式中、Rは下記の機能性分子の群から選択され、nは1~11までの整数を表す。)

によって表される化合物に関する。

【化24】

また、本発明は、下記一般式(I):

【化25】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。) で表される化合物を製造するための方法であって、下記工程 a) ~ b) の1つ を含む、前記方法に関する:

a) 下記一般式(II)

【化26】

(式中、nは1~11までの整数を表す。)で表される化合物を、機能性分子のOSuまたはOPfpとの活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

b) 下記一般式(III)

【化27】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。

-) で表される化合物を、加水分解する工程、および
- c) 下記一般式(IV)

【化28】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。

) で表される化合物を、下記一般式 (V)

【化29】

で表される化合物と反応せしめる工程。

さらに、本発明は、機能性PNAオリゴマーを製造するための方法であって、下記一般式(I)

【化30】

(式中、BはH、機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)

で表される化合物の1種または2種以上を結合したPNAオリゴマーにおいてBのうち、H、または保護基の一部またはすべてについて順次または同時に機能性分子によって置換する工程を含む、前記方法に関する。

またさらに、本発明は、Rが、

【化31】

からなる群から選択される、前記方法に関する。

さらにまた、本発明は、一般式(I)で表される化合物が、下記 a) $\sim c$)の 工程の1つによって製造される、前記方法に関する:

a) 下記一般式(II)

【化32】

(式中、nは1~11までの整数を表す。)で表される化合物を、機能性分子の

OSuまたはOPfpとの活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

b) 下記一般式(III)

【化33】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。) で表される化合物を、加水分解する工程、および

c) 下記一般式(IV)

【化34】

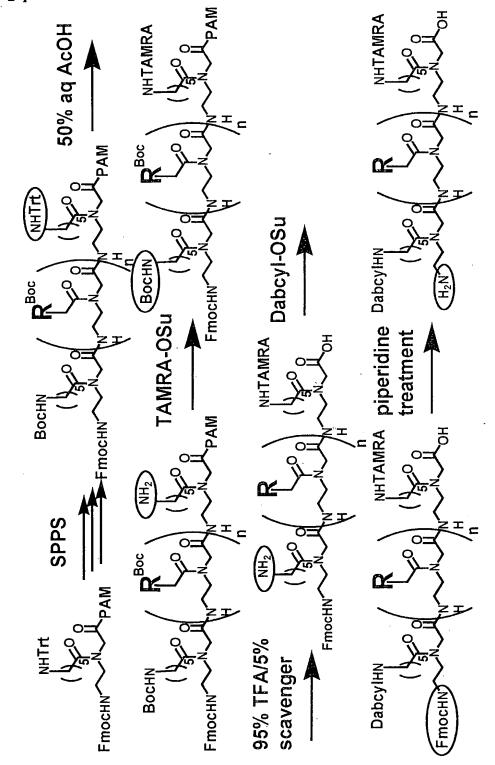
(式中、R は機能性分子または保護基を表し、n は $1\sim1$ 1 までの整数を表す。)で表される化合物を、下記一般式(V)

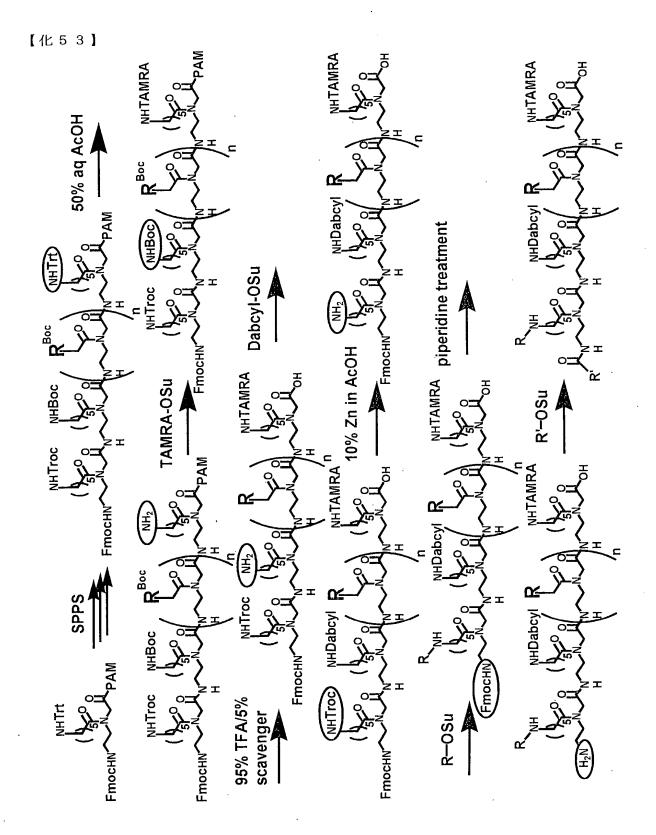
【化35】

で表される化合物と反応せしめる工程。

また、本発明は、機能性分子が、光放出性分子、光消失性分子、膜透過機能性分子、臓器選択性機能性分子、殺菌性機能性分子、分子認識性機能性分子、光架







4 5

請 求 の 範 囲

1. (補正後)下記一般式(I):

【化1】

(式中、R は下記の機能性分子の群から選択され、n は $1\sim1$ 1 までの整数を表す。)

によって表される化合物。

【化2】

- 2. (削除)
- 3. (削除)
- 4. (削除)
- 5. (削除)

6. (補正後)下記一般式(I):

【化3】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を製造するための方法であって、下記工程a) $\sim c$)の1つを含む、前記方法:

a) 下記一般式(II)

【化4】

(式中、nは $1\sim1$ 1までの整数を表す。)で表される化合物を、機能性分子の OSuまたはOPfpとの活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

4 7

b) 下記一般式(III)

【化5】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。

-)で表される化合物を、加水分解する工程、および
- c) 下記一般式(IV)

【化6】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。

) で表される化合物を、下記一般式 (V)

【化7】

で表される化合物と反応せしめる工程。

7. (補正後)

機能性PNAオリゴマーを製造するための方法であって、下記一般式(I)

【化8】

(式中、BはH、機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。)

で表される化合物の1種または2種以上を結合したPNAオリゴマーにおいてBのうち、H、または保護基の一部またはすべてについて順次または同時に機能性分子によって置換する工程を含む、前記方法。

8. (補正後) Bにおける機能性分子が、

【化9】

からなる群から選択される、前記請求の範囲第10項に記載の方法。

9. (補正後) 一般式 (I) で表される化合物が、下記 a) ~ c) の工程の1つによって製造される、前記請求の範囲第6項または第7項に記載の方法:

a) 下記一般式(II)

【化10】

(式中、nは1~11までの整数を表す。)で表される化合物を、機能性分子のOSuまたはOPfpとの活性エステル誘導体または機能性分子のイソチオシアネート誘導体と反応せしめる工程、

b) 下記一般式(III)

【化11】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。

-) で表される化合物を、加水分解する工程、および
- c) 下記一般式(IV)

【化12】

(式中、Rは機能性分子または保護基を表し、nは1~11までの整数を表す。

) で表される化合物を、下記一般式 (V)